

Warszawa, 14 października 1936 r.

URZĄD PATENTOWY



Cofc 49/14

## RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ OPIS PATENTOWY

Nr 23637.

Kl. 12 q, 29/01.

F. Hoffmann-La Roche & Co. Aktiengesellschaft  
(Bazylea, Szwajcaria).

### **Sposób wytwarzania związku z kwasu salicylowego i 1-fenylo-2.3-dwumetylo-4-izopropylo-5-pyrazolonu.**

Zgłoszono 25 kwietnia 1935 r.

Udzielono 4 sierpnia 1936 r.

Pierwszeństwo: 29 stycznia 1935 r. (Szwajcaria).

Znaleziono, że kwas salicylowy łatwo łączy się z 1 - fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolonem, dając związek krystaliczny, o ile związki te poddaje się reakcji przez stopienie kwasu salicylowego z 1 - fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolonem lub przez ogrzewanie tych materiałów wyjściowych w rozpuszczalniku obojętnym. Składniki wymienione łączą się przytem w stosunkach cząsteczkowych.

Omawiany związek kwasu salicylowego z 1- fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolonem tworzy bezbarwne kryształy o punkcie topnienia 72 — 73°C i jest trudno rozpuszczalny w wo-

dzie, natomiast łatwo rozpuszcza się w większości używanych rozpuszczalników organicznych, jak w alkoholu, benzenie, eterze octowym. Ponowna krystalizacja nie zmienia związku.

Omawiany związek kwasu salicylowego z 1- fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolonem działa silnie i trwale uśmierzaąco, zwłaszcza przy cierpieniach reumatycznych. Pod tym względem znacznie przewyższa nie tylko kwas salicylowy, ale też znane, analgetycznie działające związki grupy pyrazolonowej, jak np. salicylan antipiryny. W przeciwieństwie do kwasu salicylowego otrzymany środek posiada poza tem tę zaletę, że zu-

pełnie nie drażni żołądka, a więc jest znoszony dobrze przez osoby wrażliwe. Związek ten winien znaleźć zastosowanie jako środek leczniczy.

Przykład I. 138 części wagowych kwasu salicylowego miesza się z 230 częściami wagowymi 1- fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolonu i zalewa 280 częściami wagowymi alkoholu. Przy słabem ogrzewaniu następuje całkowite rozpuszczenie się tych produktów. Przesączony roztwór zadaje się, mieszając, mniej więcej 300 częściami wagowymi wody. Otrzymany związek krystalizuje w bezbarwnych kryształach i jest od razu substancją czystą. Topnieje w temperaturze 72 — 73°C. Otrzymana wydajność jest równa prawie wydajności teoretycznej.

Przykład II. W 160 częściach wagowych benzenu rozpuszcza się, słabo ogrzewając, 138 części wagowych kwasu salicylowego i 230 części wagowych 1- fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolonu. Do przesączonego roztworu, jeszcze niezupełnie wystygłego, wprowadza się, aż do słabego zmętnienia, mniej więcej 210 części wagowych niskowrzącego e-

teru naftowego. Po zupełnem wystygnięciu oddziela się kryształy związku kwasu salicylowego i 1- fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolonu, posiadające już właściwy punkt topnienia, z wydajnością, praktycznie biorąc, odpowiadającą wydajności teoretycznej.

#### Zastrzeżenia patentowe.

1. Sposób wytwarzania związku z kwasu salicylowego i 1- fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolonu, znamienny tem, że kwas salicylowy stapia się z 1- fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolonem.

2. Odmiana sposobu według zastrz. 1, znamienna tem, że kwas salicylowy i 1- fenylo - 2,3 - dwumetylo - 4 - izopropylo - 5 - pyrazolon ogrzewa się w rozpuszczalniku obojętnym.

F. Hoffmann - La Roche & Co.

Aktiengesellschaft.

Zastępca: Inż. Cz. Raczyński,  
rzecznik patentowy.